

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.**

PAT-NO: JP401186811A

DOCUMENT-IDENTIFIER: JP 01186811 A

TITLE: SKIN BEAUTIFYING
COSMETIC

PUBN-DATE: July 26, 1989

INVENTOR-INFORMATION:

NAME
ANDO, HIDEYA
HASHIMOTO, AKIRA
SHIMIZU, MITSUAKI
KATO, HISATOYO
OZASA, YOSHIJI

ASSIGNEE-INFORMATION:

NAME	COUNTRY
SUNSTAR INC	N/A

APPL-NO: JP63011585

APPL-DATE: January 20, 1988

INT-CL (IPC): A61K007/00

ABSTRACT:

PURPOSE: To obtain a skin beautifying cosmetic exhibiting excellent synergistic effect on the elimination or prevention of melanism or pigmentation of skin with ultraviolet ray, by compounding a specific unsaturated fatty acid (derivative) and ascorbic acid, extract of placenta, kojic acid, etc.

CONSTITUTION: The cosmetic contains (A) a compound selected from a 18∼22C fatty acid containing ≥2 unsaturated bonds in a molecular structure (e.g. linoleic acid or eicosapentaenoic acid), its salt and its ester with monohydric or dihydric alcohol and (B) a

compound selected from ascorbic acid (derivative), placenta extract, kojic acid (derivative), glucosamine (derivative), azelaic acid (derivative), retinol (derivative), pyridoxine (derivative), pantothenic acid (derivative), tranexamic acid (derivative), arbutin, photo-sensitizer, sulfur, tocopherol (derivative), etc. The amounts of the components A and B in the whole cosmetic are 0.1∼10wt.% and 0.1∼10wt.%, respectively.

COPYRIGHT: (C)1989,JPO&Japio

DERWENT-ACC-NO: 1989-258961

DERWENT-WEEK: 199726

COPYRIGHT 1999 DERWENT INFORMATION LTD

TITLE: Cosmetic material giving whitening effect to skin -
contains mixt. of specified fatty acid
derivs. any one or
more of ascorbic acid, placenta extract,
kojic acid,
glucosamine etc.

PATENT-ASSIGNEE: SUNSTAR KK[SUNZ]

PRIORITY-DATA: 1988JP-0011585 (January 20, 1988)

PATENT-FAMILY:

PUB-NO	PUB-DATE	MAIN-IPC
LANGUAGE	PAGES	
JP 01186811 A	July 26, 1989	N/A

006 N/A
JP 2614474 B2 May 28, 1997 N/A
006 A61K 007/48

APPLICATION-DATA:

PUB-NO	APPL-DESCRIPTOR
APPL-NO	APPL-DATE
JP 01186811A	N/A
1988JP-0011585	January 20, 1988
JP 2614474B2	N/A
1988JP-0011585	January 20, 1988
JP 2614474B2	Previous Publ. JP 1186811
	N/A

INT-CL (IPC): A61K007/00, A61K007/48

ABSTRACTED-PUB-NO: JP 01186811A

BASIC-ABSTRACT:

A new whitening cosmetic material contains (A) 18-22C free fatty acids having at least two unsatd. and their salts and esters with nono- and dihydric alcohols; and (B) one or or more of ascorbic acid and

its derivs, placenta extract, kojic acid and its derivs., glucosamine and its derivs., azelaic acid and its derivs., retinol and its derivs., pyridoxine and its derivs., tranexamic acid and its derivs., arbutin, photosensitive elements, sulphur, tocopherol and its derivs., chondroitin sodium sulphate, 4-hydroxy-cinnamic acid, and carrot extract.

USE - For providing a cosmetic which effectively prevents the darkening of the skin and pigment deposition by UV light.

CHOSEN-DRAWING: Dwg.0/0

DERWENT-CLASS: D21 E19

CPI-CODES: D08-B09A; D09-E; E06-A01; E07-A02B; E07-A02F; E07-A02H; E07-D04C; E10-C02D; E10-C03; E10-C04L; E10-E04K; E10-E04M1; E10-G02G;

----- KWIC -----

Document Identifier - DID (1):

JP 01186811 A

⑫ 公開特許公報 (A)

平1-186811

⑬ Int.Cl.

A 61 K 7/00

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 平成1年(1989)7月26日

X-7306-4C

審査請求 未請求 請求項の数 1 (全6頁)

⑮ 発明の名称 美白化粧料

⑯ 特 願 昭63-11585

⑯ 出 願 昭63(1988)1月20日

⑰ 発明者	安藤秀哉	京都府八幡市男山香呂6番地
⑰ 発明者	橋本晃	大阪府高槻市牧田町14-86-307
⑰ 発明者	清水満章	京都府京都市中京区西ノ京北円町14-2
⑰ 発明者	加藤久豊	大阪府高槻市上土室2丁目10-1
⑰ 発明者	小笠祥次	滋賀県大津市比叡平2丁目37-12
⑰ 出願人	サンスター株式会社	大阪府高槻市朝日町3番1号
⑯ 代理人	弁理士 森岡博	

明細書

1. 発明の名称

美白化粧料

2. 特許請求の範囲

(1) (a) 増素数18~22かつ分子構造中の不飽和結合数が2以上の遊離脂肪酸、その塩、あるいは一価または二価アルコールとのエステル、(b) アスコルビン酸及びその誘導体、胎盤抽出物、コウジ酸及びその誘導体、グルコサミン及びその誘導体、アゼライン酸及びその誘導体、レチノール及びその誘導体、ビリドキシン及びその誘導体、バントテン酸及びその誘導体、トラネキサム酸及びその誘導体、アルブチン、感光素、イオウ、トコフェロール及びその誘導体、コンドロイチン硫酸ナトリウム、4-ヒドロキシケイ皮酸、並びにニンジンエキスからなる群より選ばれた1種または2種以上の成分を配合したことを特徴とする美白化粧料。

3. 発明の詳細な説明

産業上の利用分野

本発明は、紫外線による皮膚の黒化あるいはシミ、リバカスなどの皮膚の色素沈着を消失、淡色化もしくは予防する美白化粧料に関する。

従来の技術および課題

従来、美白化粧料組成物としてはビタミンCおよびその誘導体、あるいは還元剤、胎盤エキスなどのチロジナーゼ活性阻害剤を配合したものが知られている。しかしながら、これら従来の美白化粧料は培養細胞による *in vitro* の実験ではメラニン産生抑制作用などを示すものの、実際に皮膚に適用した場合、充分な色素沈着の消失もしくは淡色化などの効果は得られていない。

本発明は実際に皮膚に適用した場合、副作用がなく優れた美白効果を奏しうる化粧料を提供することを目的とする。

課題を解決するための手段

本発明者らは、前記目的を達成すべく試験研究を重ねた結果、特定の脂肪酸またはその誘導体にさらに各種の成分を組み合わせることにより皮膚の色素沈着の消失、もしくは淡色化に優れた相乗

的な効果があらわれることを見いだし、本発明を完成するに至った。

すなわち本発明は、(a) 炭素数18～22かつ分子構造中の不飽和結合数が2以上の遊離脂肪酸、その塩、あるいは一価または二価アルコールとのエステル、(b) アスコルビン酸及びその誘導体、胎盤抽出物、コウジ酸及びその誘導体、グルコサミン及びその誘導体、アゼライン酸及びその誘導体、レチノール及びその誘導体、ビリドキシン及びその誘導体、パントテン酸及びその誘導体、トラネキサム酸及びその誘導体、アルブチン、感光素、イオウ、トコフェロール及びその誘導体、コシドロイチン硫酸ナトリウム、4-ヒドロキシケイ皮酸、並びにニンジンエキスからなる群より選ばれた1種または2種以上の成分を配合したことを特徴とする美白化粧料を提供するものである。

本発明組成物に配合されるリノール酸、ケーリノレン酸など炭素数18～22を有し、かつ分子構造中の不飽和結合数が2以上の脂肪酸は、植物油脂および動物油脂に含まれている。しかし、こ

うム塩、カリウム塩などの金属塩、アルギニン塩、リジン塩などのアミノ酸塩、トリエタノールアミン塩、モノエタノールアミン塩等のアミン塩などが挙げられる。

さらに、前記遊離脂肪酸のアルキルエステルとしては、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコールなどの一価アルコールとのエステル、エチレングリコール、プロピレングリコール、1,3-ブチレングリコールなどの二価のアルコールとのエステルなどが挙げられる。

これら遊離脂肪酸、塩、またはエステルの化粧料中における配合量は、0.1～1.0重量%であるのが好ましい。かかる配合量が、0.1重量%未満であると、色素沈着の淡色化効果がなく、一方、1.0重量%を越えると、皮膚に対して刺激性を示すようになる。

一方、前記脂肪酸等と共に本発明組成物に配合される成分は、アスコルビン酸及びその塩あるいはエステル、胎盤抽出物、コウジ酸及びその塩あるいはエステル、グルコサミン及びその塩あるい

れら脂肪酸は遊離の状態で存在することは少なく、そのほとんどはトリグリセリドの状態で存在する。このようなトリグリセリドは、遊離の脂肪酸もしくはそのアルキルエステルのごとく動物試験等において優れた色素沈着淡色化作用は認められない。また、バルミチン酸、ステアリン酸などの飽和脂肪酸にあっても同様に色素沈着抑制効果は認められず、場合によっては逆にメラニン産生を亢進する。かかる飽和脂肪酸は、植物油脂および動物油脂に多量にふくまれているため、本発明化粧料におけるリノール酸などの配合にあたっては精製したものをおいことが好ましい。

本発明の美白化粧料に配合される炭素数18～22かつ分子構造中の不飽和結合数が2以上の遊離脂肪酸の代表的なものとしては、リノール酸、リノエライジン酸、α-リノレン酸、γ-リノレン酸、ジホモ-γ-リノレン酸、アラキドン酸、エイコサペンタエン酸などが挙げられ、これらの1種または2種以上が用いられる。

また、これら遊離脂肪酸の塩としては、ナトリ

はエステル、アゼライン酸及びその塩あるいはエステル、レチノール及びそのエステル、ビリドキシン及びその塩あるいはエステル、パントテン酸及びその塩あるいはエステル、トラネキサム酸及びその塩あるいはエステル、アルブチン、感光素、イオウ、トコフェロール及びその脂肪酸エステル、コシドロイチン硫酸ナトリウム、4-ヒドロキシケイ皮酸、並びにニンジンエキスである。これらの1種または2種以上が配合される。これら成分の化粧料組成物中における配合量は0.1～1.0重量%であるのが好ましい。かかる配合量が0.1重量%未満であると、色素沈着の淡色化効果がなく、一方、1.0重量%を越えると刺激性が強く、使用上好ましくない。

これらの活性成分と前記脂肪酸類との併用により皮膚に対し相乘的な美白効果を示すことについては從来知られていない。

つぎに各種活性成分についてその色素沈着の消失もしくは淡色化の作用を評価した結果を示す。

試験方法：

English 級茶色モルモットの背部を剃毛して紫外線(UVB強度: 1 J/cm²)を照射し、1週間後に色素沈着を得た。つぎに、この部位にリノール酸をはじめとする脂肪酸、あるいは他の成分をエタノールに溶解した検体を4週間累積塗布した。色素沈着の淡色化を評価する方法として、検体を塗布していない部位(無塗布)の色素沈着度を0とし、その淡色化の度合いにより、以下に示す判定基準に従い、色素沈着度を肉眼判定した。

判定基準：

- 0 色素沈着の淡色化が認められない
- 1 わずかに色素沈着の淡色化が認められる
- 2 中等度の色素沈着の淡色化が認められる
- 3 著著な色素沈着の淡色化が認められる

結果を次の第1表に示す。

第1表

成 分	配合量(重量%)															
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16
リノール酸	0.5															
リノエイジン酸		0.5														
アーリノレン酸			0.5													0.5
ジキモーテーリノレン酸				0.5												
アラキドン酸					0.5											
ローリノレン酸						0.5										
エイコサヘキサエン酸							0.5									0.5
ドコサヘキサエン酸								0.5								0.5
リノール酸エチル									0.5							
リノール酸ナトリウム										0.5						
アスコルビン酸											0.5					
アスコルビン酸ガリコン酸												0.5				
胎盤油出物													0.5			
コウジ酸														0.5		
アルコサミン															0.5	
アゼライン酸																0.5
レチノール																0.5
酢酸レチノール																0.5
ビリドキシン																0.5
塗膜ビリドキシン																0.5
バントテン酸																0.5
トランキサン酸																0.5
アルブチン																0.5
感光素																0.5
イオウ																0.5
トコフェロール																0.5
シリカ5%乳化油																0.5
精製水																0.5
効果	-3	-3	-3	-3	-3	-3	-2	-2	-2	-2	-2	-2	-2	-2	-2	-2

成 分	配 合 量 (重量 %)															
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16
リノール酸																
リノエチジン酸	0.5															
アーリノレン酸		0.5														
ジホモーアーリノレン酸			0.5													
アラキドン酸				0.5												
ローリノレン酸					0.5											
エイコサヘキサエン酸						0.5										
ドコサヘキサエン酸							0.5									
リノール酸エチル								0.5								
リノール酸ナトリウム									0.5							
アスコルビン酸										0.5						
DLα,β-ヒドロキシアラニン											0.5					
結晶油出物												0.5				
コウジ酸													0.1			
グルコサミン													0.1			
アセライン酸													0.5			
レチノール														0.1		
酢酸レチノール														0.1		
ビリドキシン														0.1		
塩酸ビリドキシン															0.5	
バントテン酸														0.5		
トランキサン酸															0.5	
アルブチン																0.5
感光素																0.5
イオウ																0.5
トコフェロール																0.5
カルボン酸																0.5
ニンジンエキス																0.5
エチアルコール																0.5
新鮮牛乳(40%)炭化水素	1.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0
精製水																
効量	0	-1	-2	-2	-1	-1	-1	0	0	0	-1	0	-1	0	-1	0

第1表より明らかなごとく、アスコルビン酸などの活性成分単独では色素沈着の淡色化は認められず、また炭素数18～22かつ分子構造中の不飽和結合数が2以上の遊離脂肪酸、その塩あるいはアルキルエステルを単独で配合した場合も、色素沈着の淡色化はわずかである。これらに対して、前記脂肪酸、その塩あるいはエステルとアスコルビン酸などの成分を併用した場合は、顕著な色素沈着の淡色化が認められる。

本発明の美白化粧料は、公知の方法により、化粧水、化粧用油、クリーム、乳液、パック、パウダーなどの形態に製造される。

さらに本発明の化粧料には、その種類に応じて性能を損なわない範囲において、通常公知の成分を配合することができる。

なお、従来から使用されている紫外線吸収剤、紫外線吸収剤、抗炎剤、抗酸化剤などを配合しても良い。

24 例

つぎに本発明を実施例によりさらに具体的に説

明する。

实施例1 (化妆水)

成 分	配合量(重量%)
アスコルビン酸リノ酸マグネシウム塩	0.5
リノール酸	0.5
α -リノレン酸	0.5
グリセリン	6.0
エタノール	8.0
ポリオキシエチレン(800)硬化ヒマシ油	0.8
パラオキシ安息香酸メチル	0.05
クエン酸	0.05
クエン酸ナトリウム	0.07
香料	0.1
水溶性プラセンタエキス	2.0
精製水	残部

精製水にグリセリン、クエン酸、クエン酸ナトリウム、水溶性プラセンタエキスを溶解する。別個にエタノールにアスコルビン酸リシン酸マグネシ

ウム塩、リノール酸、 α -リノレン酸、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油(60E.O.)、メチルパラベン、香料を溶解し、前記の精製水浴液に加えて可溶化し、ろ過して化粧水を得た。

実施例2(化粧用油)

成 分	配合量(重量%)
トコフェロール	0.2
4-ヒドロキシケイ皮酸	0.2
リノール酸エチル	1.0
エイコサペンタエン酸	1.0
バルミチン酸アスクルビル	0.2
酢酸レチノール	0.3
リノール酸コレステリル	1.0
月見草油	2.0
スクワラン	微量

スクワランに他の成分を均一に溶解して化粧用油を得た。

実施例3(クリーム)

成 分	配合量(重量%)
<u>成分(A)</u>	
アルブチン	0.2
ニンジンエキス	0.2
α -リノレン酸	2.0
リノール酸エチル	1.0
ステアリン酸アスクルビル	1.0
サラシミツロウ	4.0
セタノール	2.0
ステアリン酸	1.0
ミリスチン酸イソプロピル	5.0
ラノリン	2.0
液動パラフィン	9.0
自己乳化型モノステアリン酸グリセリル	3.0
モノステアリン酸	
ポリオキシエチレンソルビタン(20E.O.)	1.5
パラオキシ安息香酸プロピル	0.1

成分(B)

パラオキシ安息香酸メチル	0.2
プロビレングリコール	5.0
香料	0.2
精製水	微量

成分(A)を加熱溶解し、80°Cに保持する。別に香料を除く成分(B)を加熱溶解して80°Cに保ち、これに前記成分(A)を搅拌しながら加え、充分混合する。さらに搅拌しながら冷却を行い、香料を加え、さらに冷却してクリームを得た。

ミツロウ 1.0

セスキオレイン酸ソルビタン 2.0

成分(B)

ポリオキシエチレン オレイルエーテル(20R.O.)	2.5
パラオキシ安息香酸エチル	0.2
プロビレングリコール	5.0
カルボキシビニルポリマー	0.5
水酸化カリウム	0.5
香料	0.2
精製水	微量

成分(A)を80°Cにて加熱溶解し、別に加温(80°C)溶解した香料を除く成分(B)に搅拌しながら加え、充分混合する。ついで、搅拌しながら冷却を行い、香料を加え、さらに冷却して乳液を得た。

実施例4(乳液)

成 分	配合量(重量%)
<u>成分(A)</u>	
アセライン酸	0.2
ビリドキシン	0.2
リノール酸イソプロピル	2.0
グリチルレチン酸ステアリル	0.1
液動パラフィン	5.0
ワセリン	2.0

実施例5(パック)

成 分	配合量(重量%)
コンドロイチン硫酸ナトリウム	0.5

α -リノレン酸	3.0
水溶性プラセンタエキス	2.0
酢酸ビニル・スチレン共重合体	10.0
ポリビニルアルコール	10.0
ソルビット	5.0
酸化チタン	8.0
カオリン	7.0
エタノール	5.0
香料	2.0
バラオキシ安息香酸エチル	0.2
精製水	残部

コンドロイチン硫酸ナトリウム、 α -リノレン酸、香料およびエタノールを均一に溶解する。これを酢酸ビニル・スチレン共重合体、ポリビニルアルコール、ソルビット、酸化チタンおよびカオリンを均一に混和したものに加える。これに、さらに水溶性プラセンタエキス、バラオキシ安息香酸エチルを精製水に均一に溶解した溶液を加え、均一に混和しパックを得た。

実施例6(パウダー)

成 分	配合量(重量%)
トラネキサム酸	0.1
イオウ	0.1
リノエライジン酸	2.0
デキストリン	94.8
タルク	2.0
ステアリン酸デカグリセリル	1.0

トラネキサム酸、イオウ、リノエライジン酸およびステアリン酸デカグリセリルを加熱溶解し、70℃に保持し、これをデキストリンおよびタルクの混合物に攪拌しながら徐々に加えてパウダーを得た。

発明の効果

本発明化粧料は、皮膚に適用することにより、紫外線による皮膚の黒化あるいは色素沈着を消失、淡色化もしくは予防し優れた美白効果を発揮する。